## (12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro





(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 6. Februar 2003 (06.02.2003)

**PCT** 

# (10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO~03/009687~A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A01N 43/90, C07D 487/04 // (C07D 487/04, 249:00, 239:00)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/07893

(22) Internationales Anmeldedatum:

16. Juli 2002 (16.07.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 101 36 118.1 26. Juli 2001 (26.07.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Limburgerhof (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim (DE). MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, 67227 Frankenthal (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel-Hahnemann-Weg 9, 67071 Ludwigshafen (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Höhnhausen 18, 67157

Wachenheim (DE). **GYPSER, Andreas** [DE/DE]; B 4,4, 68159 Mannheim (DE). **RHEINHEIMER, Joachim** [DE/DE]; Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen (DE). **ROSE, Ingo** [DE/DE]; C 2, 19, 68159 Mannheim (DE). **SCHÄFER, Peter** [DE/DE]; Römerstrasse 1, 67308 Ottersheim (DE). **SCHIEWECK, Frank** [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). **AMMERMANN, Eberhard** [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, 64646 Heppenheim (DE). **STRATHMANN, Siegfried** [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). **LORENZ, Gisela** [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Hambach (DE). **STIERL, Reinhard** [DE/DE]; Ginsterstrasse 17, 67112 Mutterstadt (DE).

- (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-SELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GII, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

- (54) Title: 7-AMINO TRIAZOLOPYRIMIDINES FOR CONTROLLING HARMFUL FUNGI
- (54) Bezeichnung: 7-AMINOTRIAZOLOPYRIMIDINE ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN

(57) Abstract: The invention relates to 7-amino triazolopyrimidines of formula (I), in which the substituents have the following meanings: R¹, R² represent hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, phenyl, naphthyl; or 5-membered or 6-membered heterocyclyl containing one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; or 5-membered or 6-membered heteroaryl containing one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom, or R¹ and R² can, together with the nitrogen atom, which binds them, form a 5-membered or 6-membered ring containing one to four nitrogen atoms or one to three nitrogen atoms and one sulfur or oxygen atom; R³ represents alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, phenylalkyl and alkyl halide; whereby R³ and R² can be unsubstituted or partially or completely substituted according to the description; X represents halogen, cyano, alkoxy, alkyl halide, phenyl or phenyl that is substituted by R³. The invention also relates to methods and intermediate products for producing said compounds, to agents containing the same, and to their use.

(57) **Zusammenfassung:** 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben: R¹, R² Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; oder 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom, oder R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält; R³ Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Phenylalkyl und Haloalkyl; wobei R³ und R² unsubstituiert oder teilweise oder vollständig gemäss der Beschreibung substituiert sein können; X Halogen, Cyano, Alkoxy, Haloalkyl, Phenyl oder durch R³ substituiertes Phenyl; Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung.

WO 03/009687 A1

### WO 03/009687 A1



DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

#### Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

#### 7-AMINOTRIAZOLOPYRIMIDINE ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I,

10

15

$$\begin{array}{c|c}
\mathbb{R}^{1} & \mathbb{R}^{2} \\
\mathbb{N} & \mathbb{N} & \mathbb{R}^{3}
\end{array}$$

$$\mathbb{I}$$

in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

20 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff,  $C_1-C_{10}-Alkyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkenyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkinyl$ ,  $C_3-C_8-Cycloalkyl$ , Phenyl, Naphthyl; oder

5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom,

30

35

40

25

wobei  $R^1$  und  $R^2$ , wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^a$ 

Ra Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylenoxy,

tragen können; oder

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält,

2

und der durch ein bis drei Reste aus der Gruppe Ra substituiert sein kann;

 $R^3$   $C_1-C_{10}-Alkyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkenyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkinyl$ ,  $C_3-C_8-Cyclo-alkyl$ , Phenyl- $C_1-C_{10}-Alkyl$ ,

wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R<sup>a</sup> tragen kann, oder

10

 $C_1-C_{10}$ -Haloalkyl, das ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^a$  tragen kann;

Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkyl, Phenyl oder
 durch R<sup>a</sup> substituiertes Phenyl;

sowie deren Salze.

Zusätzlich betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte 20 zur Herstellung der Verbindungen I, sowie Mittel und die Verwendung der Verbindungen I zur Bekämpfung von Schadpilzen.

6-Aryl-Triazolopyrimidine werden in WO 98/46608 und EP-A 550 113 offenbart. Durch aromatische Gruppen speziell substituierte

- 25 6-Benzyl-Triazolopyrimidine mit pharmazeutischer Wirkung sind aus US 5,231,094 und US 5,387,747 bekannt. EP-A 141 317 offenbart 7-Aminotriazolopyrimidine, welche in 5-Position einen Alkylrest tragen können. 6-Cycloalkyltriazolopyrimidine mit diversen Resten in 5-Position werden in EP-A 613 900 genannt.
- Die in WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317 und EP-A 613 900 beschriebenen Verbindungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.
- 35 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I gefun-40 den. Weiterhin wurden Zwischenprodukte und Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I, sowie die Verwendung der Verbindungen I und diese enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen gefunden. 3

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den oben genannten Schriften bekannten Verbindungen durch die Kombination der Substituenten X mit dem Rest R<sup>3</sup> am Triazolopyrimidingerüst.

5

Verbindungen der Formel I, wobei X Halogen bedeutet, erhält man beispielsweise ausgehend von Dicarbonylverbindungen der Formel II.1, welche man mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III zu Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV.1 cyclisiert:

10

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25 °C 20 bis 210 °C, vorzugsweise 120 °C bis 180 °C, in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A-770615].

Als Basen kommen allgemein organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Triisopropylethylamin, Tri25 butylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin in Betracht. Besonders bevorzugt werden Triethylamin und Tributylamin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebe-30 nenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, II.1 in einem Überschuß bezogen auf III einzusetzen.

35

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe sind in der Literatur bekannt oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden [Heterocycl. 1996, pp. 1031 - 1047; Tetrahedron Lett. 1966, 24, 2661 - 2668] oder sind 40 kommerziell zugänglich.

Anschließend setzt man die Hydroxytriazolopyrimidine der Formel IV.1 mit einem Halogenierungsmittel zu Halogentriazolopyrimidinen der Formel V.1 um:

4

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis 150 °C, vorzugsweise 80 °C bis 125 °C, in einem inerten orga10 nischen Lösungsmittel oder ohne zusätzliches Lösungsmittel [vgl.EP-A-770 615].

Geeignete Halogenierungsmittel sind bevorzugt Bromierungs- oder Chlorierungsmittel, wie beispielsweise Phosphoroxybromid oder 15 Phosphoroxychlorid, in Substanz oder in Anwesendheit eines Lösungsmittels.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlen20 wasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, besonders bevorzugt Toluol, o-, m- und p-Xylol.

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

25

Anschließend setzt man die Halogentriazolopyrimidine der Formel V.1 mit einem Amin der Formel VI zu 7-Aminotriazolopyrimidinen der Formel I um, in der X Halogen bedeutet:

30

$$V.1 \xrightarrow{\mathbb{R}^{\frac{1}{N}} \mathbb{R}^{2}} VI \xrightarrow{\mathbb{R}^{\frac{1}{N}} \mathbb{R}^{2}} I$$

35

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis 70 °C, vorzugsweise 10 °C bis 35 °C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A-550 113].

40

Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran.

5

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calziumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide wie Lithiumoxid, Natriumoxid, Calziumoxid 5 und Magnesiumoxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calziumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calziumcarbonat sowie Alkalimetallhydrogen-10 carbonate wie Natriumhydrogencarbonat, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle wie Methyllithium, Butyllithium und Phenyllithium, Alkylmagnesiumhalogenide wie Methylmagnesiumchlorid sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kaliumethanolat, 15 Kalium- tert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden 20 Triethylamin, Kaliumcarbonat und Natriumcarbonat.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden. Alternativ dazu kann ein Überschuß der Verbindung VI als Base dienen.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, VI in einem Überschuß bezogen auf V.I einzusetzen.

Um 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I zu erhalten, in denen X Cyano oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy bedeutet, werden 7-Aminotriazolo-pyrimidine der Formel I mit einer Verbindung der Formel VII umgesetzt:

30

Dabei bedeutet M ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkalimetall- oder Erdalkalimetallkation und X' Cyano oder Alkoxy.

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0 °C bis 150 °C, vorzugsweise 20 °C bis 75 °C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. WO 99/41255].

Geeignete Lösungsmittel sind Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Diethylether, Tetrahydrofuran, Methanol und Dimethylformamid.

Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, VII in einem Überschuß bezogen auf I einzusetzen.
- 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I, in der X C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkyl oder gegebenenfalls durch R<sup>a</sup> substituiertes Phenyl bedeutet, sind erhältlich ausgehend von Dicarbonylverbindungen der Formel II.2, die man mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV-2-cyclisiert:

25

Diese Umsetzung erfolgt unter den gleichen Bedingungen wie die vorstehend beschriebene Umsetzung von II.1 zu IV.1.

Anschließend setzt man die 7-Hydroxytriazolopyrimidine der Formel IV.2 mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel V,2 um:

40

Diese Umsetzung erfolgt unter den gleichen Bedingungen wie die vorstehend beschriebene Umsetzung von IV.1 zu V.1.

Dann wird Verbindung V.2 mit einem Amin der Formel VI zu Verbin-5 dungen der Formel I, umgesetzt:

Diese Umsetzung erfolgt unter den gleichen Bedingungen wie die 15 vorstehend beschriebene Umsetzung von V.1 zu I.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

7-Hydroxy- und 7-Halogentriazolopyrimidine der Formeln IV und V,

30

wobei Y für eine Hydroxygruppe oder einen Rest aus der Gruppe X 40 gemäß Anspruch 1 steht, Hal Halogen bedeutet und R<sup>3</sup> sowie X die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, sind neu.

Besonders bevorzugt werden Zwischenprodukte der Formeln IV und V, in denen R<sup>3</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, insbesondere CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-CH<sub>3</sub>, 45 CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>, C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>-CH<sub>3</sub>, CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, insbesondere CH<sub>2</sub>-CH=CH<sub>2</sub>, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopropylmethyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phe-

nyl- $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl, insbesondere  $CH_2$ - $C_6H_5$ ,  $CH_2$ -o-Cl- $C_6H_4$ ,  $C_1$ - $C_{10}$ -Halo-alkyl, insbesondere  $CH_2$ - $CF_3$ ,  $CH(CH_3)$ - $CF_3$ ,  $CH(CF_3)_2$ , und X Halogen, insbesondere Chlor, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, insbesondere OCH<sub>3</sub>,  $C_1$ - $C_4$ -Haloalkyl, insbesondere CF<sub>3</sub>, Phenyl oder durch  $R^a$  substituiertes Phenyl, insbesondere Phenyl sind.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

10

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.

- 15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl,
- 20 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl,
  2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl,
  1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;
- 25 Haloalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise, beispielsweise ein- bis dreifach, oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B.  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl wie Chlormethyl,
- 30 Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2,2-Dich-2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dich-
- 35 lor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

40

Haloalkoxy: geradkettige oder verzweigte Halogenalkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

9

5 Alkylamino: eine geradkettige oder verzweigte Alkylgruppe mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Aminogruppe (-NH-) an das Gerüst gebunden ist;

Dialkylamino: zwei voneinander unabhängige geradkettige oder ver10 zweigte Alkylgruppen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie
vorstehend genannt), welche über ein Stickstoffatom an das Gerüst
gebunden sind;

Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasser-15 stoffreste mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C2-C6-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 20 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propēnyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-25 propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 30 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-35 butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 40 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Alkenyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten, 45 Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom

position (wie vorstehend genannt), welche über ein sauerstoffator (-O-) an das Gerüst gebunden sind; Alkiny1: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen
mit 2 bis 6 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung
in einer beliebigen Position, z.B. C2-C6-Alkinyl wie Ethinyl,
1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl,
5 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,
1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,
3-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl,
1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und
15 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Alkinyloxy: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbar-20 ten, Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

Cycloalkyl: monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 5, 6,oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cyclo-25 alkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

5- oder 6-gliedrige Heterocyclen (Heterocyclyl) enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis vier Stickstoffatome und/oder ein . 30 Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- und/oder Schwefelatom, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidi-35 nyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-y1, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-y1, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazoli-40 din-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 45 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazo-

lin-5-yl, 2-Isothiazolin-3-yl, 3-Isothiazolin-3-yl, 4-Isothiazolin-3-yl, 2-Isothiazolin-4-yl, 3-Isothiazolin-4-yl, 4-Isothiazolin-4-yl, 2-Isothiazolin-5-yl, 3-Isothiazolin-5-yl, 4-Isothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl,

- 5 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxa-
- 10 zol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Di-hydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahy-
- 15 dropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;
- 20 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder ent-
- 25 halten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazo-
- 30 lyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadia-zol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH2-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH2O, OCH2CH2O und OCH2CH2CH2O;

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es in der Regel nicht auf die Art des Salzes ankommt. Im Allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen 5 Säuren in Betracht, deren Kationen beziehungsweise Anionen die fungizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchti-

Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vor10 zugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei
hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch  $C_1-C_4-Alkyl$ , Hydroxy $-C_1-C_4-alkyl$ ,  $C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl$ ,

gen.

- 15 Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydro-xyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren, Phosphoniumionen, Sufoniumio-
- 20 nen, vorzugsweise Tri $(C_1-C_4-alkyl)$  sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri $(C_1-C_4-alkyl)$  sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionssalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogensulfat,

- 25 phosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexaflourosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von  $C_1$ - $C_4$ -Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.
- 30 Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:
- 35 Verbindungen I, in denen  $R^1$ ,  $R^2$  für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkyl, insbesondere für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Haloalkyl, besonders bevorzugt für Wasserstoff, 1-Methylpropyl, Isopropyl oder 1,1,1-Trifluor-2-propyl steht, oder
- 40 R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5-oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein Sauerstoffatom enthalten kann und/oder einen  $C_1$ - $C_4$ -Alkylrest tragen kann, beispielsweise Pyrrolidin-1-yl, Pyrrol-1-yl, Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, Piperidin-1-yl, Morpholin-4-yl, wobei die genannten
- 45 Reste durch ein bis drei Reste  $R^a$ , insbesondere  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, wie beispielsweise Methyl oder Ethyl, substituiert sein können.

13

Daneben werden auch Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^1$  Wasserstoff,  $C_1-C_6-Alkyl$  und  $C_1-C_4-Haloalkyl$  und  $R^2$  Wasserstoff bedeutet.

**5** Ganz besonders werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^1$  und  $R^2$  Wasserstoff und  $R^3$   $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl bedeuten.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^3$  10  $C_1$ - $C_8$ -Alkyl, insbesondere Isopropyl oder n-Octyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, besonders bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, oder  $CH_2$ - $C_6H_5$  bedeutet.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^3$  15  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, insbesondere  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, besonders bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, und X Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, beispielsweise OCH<sub>3</sub>,  $C_1$ - $C_4$ -Haloalkyl, beispielsweise CF<sub>3</sub> oder ein gegebenenfalls durch  $R^a$  substituiertes Phenylalkyl, beispielsweise  $CH_2$ - $C_6H_5$  oder  $CH_2$ -o-Cl- $C_6H_4$ , bedeutet.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^3$   $C_3-C_8$ -Cycloalkyl, insbesondere  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl, besonders bevorzugt Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl, und X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen X Halogen, wie Chlor oder Brom, insbesondere Chlor bedeutet.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den fol30 genden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die
in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen
außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in
der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des
betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

35

40

45

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 2 Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $\mathrm{CH_2-CH_3}$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

14

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_3-CH_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH(CH_3)_2$  und X für CI steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 5

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 6

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $C(CH_3)_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 7

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_7$ - $CH_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 8

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_2$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 9

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopentyl und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 10

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclohexyl und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 11

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-C_6H_5$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 12

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -o- $Cl-C_6H_4$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 13

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_2$ - $CH_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 14

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH=CH_2$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 15

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopropyl-methyl und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 16

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_2-CN$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 17

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CF_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 18

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CF_3$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 19

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $CH(CF_3)_2$  und X für Cl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 20

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

16

Tabelle 21

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 22

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_3-CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 23

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH(CH_3)_2$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 24

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 25

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 26

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_7$ - $CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 27

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_2$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 28

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopentyl und X für  $\mathbb{CF}_3$  steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 29

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclohexyl und X für  $\mathbb{CF}_3$  steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

17

Tabelle 30

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-C_6H_5$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 31

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -p-Cl-C<sub>6</sub> $H_4$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 32

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_2$ - $CH_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 33

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH=CH_2$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 34

Verbindungen der Formel I, in denen R<sup>3</sup> für Cyclopropyl-methyl und X für CF<sub>3</sub> steht und die Kombination der Reste R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 35

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_2-CN$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 36

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CF_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 37

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CF_3$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 38

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CF_3)_2$  und X für  $CF_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

18

Tabelle 39

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 40

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 41

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_3-CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 42

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ - $CH(CH_3)_2$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 43

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 44

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 45

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_7$ - $CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 46

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_2$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 47

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopentyl und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

19

Tabelle 48

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclohexyl und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 49

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-C_6H_5$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 50

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -p- $Cl-C_6H_4$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 51

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_2$ - $CH_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 52

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -CH= $CH_2$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 53

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopropyl-methyl und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 54

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $-CH_2-CH_2-CN$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 55

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CF_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 56

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CF_3$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 57

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CF_3)_2$  und X für Phenyl steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 58

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 59

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $CH_2-CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 60

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_3-CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 61

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH(CH_3)_2$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 62

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 63

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 64

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_7$ - $CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 65

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_2$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

21

Tabelle 66

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für Cyclopentyl und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 67

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclohexyl und X für CN steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 68

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-C_6H_5$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 69

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -p- $Cl-C_6H_4$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 70

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_2-CH_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 71

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH=CH_2$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 72

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopropyl-methyl und X für CN steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 73

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_2-CN$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 74

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ - $CF_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

22

Tabelle 75

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CF_3$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 76

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CF_3)_2$  und X für CN steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 77

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 78

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für  $CH_2-CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 79

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_3-CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 80

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH(CH_3)_2$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 81

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 82

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 83

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_7$ - $CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

23

Tabelle 84

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)_2$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 85

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopentyl und X für OCH3 steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 86

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclohexyl und X für OCH $_3$  steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 87

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-C_6H_5$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 88

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2$ -p- $Cl-C_6H_4$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A-entspricht

25

Tabelle 89

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $(CH_2)_2$ - $CH_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 90

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH=CH_2$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 91

Verbindungen der Formel I, in denen  $\mathbb{R}^3$  für Cyclopropyl-methyl und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 92

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CH_2-CN$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

**WO** 03/009687 24

#### Tabelle 93

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH_2-CF_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

PCT/EP02/07893

5

#### Tabelle 94

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CH_3)-CF_3$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprich

10

#### Tabelle 95

Verbindungen der Formel I, in denen  $R^3$  für  $CH(CF_3)_2$  und X für  $OCH_3$  steht und die Kombination der Reste  $R^1$  und  $R^2$  für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle A

25	No.	R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$
	A-1	H	H
	A-2	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
	A-3	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	A-4	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
50	A-5	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H
	A-6	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-7	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-8	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	H
35	A-9	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-10	CH <sub>2</sub> CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-11	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
	A-12	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
40	A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-15	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
	A-16	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-17	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-18	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ - $CH_2CH_3$	H
45	A-19	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ - $CH_2CH_3$	CH <sub>3</sub>
	A-20	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-21	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H

PCT/EP02/07893

Γ	37	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
	No.		
	A-22	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-23	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
5	A-24	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H
	A-25	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
,	A-26	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-27	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
10	A-28	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-29	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-30	$(R)$ CH $(CH_3)$ -CH $(CH_3)_2$	H
	A-31	(R) $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>
	A-32	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
15	A-33	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
	A-34	(S) $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	CH <sub>3</sub>
	A-35	(S) $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-36	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	. , H
	A-37	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -C $(CH_3)_3$	CH <sub>3</sub>
	A-38	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -C $(CH_3)_3$	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
20	A-39	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
<b>.</b>	A-40	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-41	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-42	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
-n= ·	A-43	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	· CH <sub>3</sub> -
25	A-44	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-45	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
	A-46	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-47	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-48	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H
30	A-49	(R) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-50	$(R)$ CH $(CH_3)$ -CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-51	(S) $CH(CH_3)-CF_3$	H .
	A-52	(S) $CH(CH_3)-CF_3$	CH <sub>3</sub>
	A-53	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
35	A-54	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -CCl <sub>3</sub>	H
	A-55	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ -CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	A-56	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
:	A-57	$(R)$ CH $(CH_3)$ -CCl <sub>3</sub>	Н
	A-58	$(R)$ CH $(CH_3)$ -CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40	A-59	$(R)$ CH $(CH_3)$ -CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-60	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	H
	A-61	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45	A-62	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CCl <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	A-63	$CH_2C(CH_3) = CH_2$	H
	A-64	$CH_2C(CH_3) = CH_2$	CH <sub>3</sub>
	A-65	$CH_2C(CH_3)=CH_2$	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	** A.	VZ ( V3 / VZ	3

No.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	
A-66	cyclopentyl	H	
A-67	cyclopentyl	CH <sub>3</sub>	
A-68	cyclopentyl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	
A-69	$-(CH_2)_2CH(CH_3)(CH_2)_2-$		

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>a</sup>, 10 R<sup>3</sup> und X der Formel I.

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der 15 Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl 20 von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

25

5

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- . Alternaria-Arten, Podosphaera-Arten, Sclerotinia-Arten, Physalospora canker an Gemüse und Obst,
  - . Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
  - . Corynespora cassiicola an Gurken,
  - . Colletotrichum-Arten an Obst und Gemüse,
- 35. Diplocarpon rosae an Rosen,
  - . Elsinoe fawcetti und Diaporthe citri an Citrus-Früchten,
  - . Sphaerotheca-Arten an Kürbisgewächsen, Erdbeeren und Rosen,
  - . Cercospora-Arten an Erdnüssen, Zuckerrüben und Auberginen,
  - . Erysiphe cichoracearum an Kürbisgewächsen,
- 40. Leveillula taurica an Paprika, Tomaten und Auberginen,
  - . Mycosphaerella-Arten an Äpfeln und japanischer Aprikose,
  - . Phyllactinia kakicola, Gloesporium kaki, an japanischer Aprikose,
  - . Gymnosporangium yamadae, Leptothyrium pomi, Podosphaera leu-
- 45 cotricha und Gloedes pomigena an Äpfeln,
  - Cladosporium carpophilum an Birnen und japanischer Aprikose,
  - . Phomopsis-Arten an Birnen,

27

- Phytophthora-Arten an Citrusfrüchten, Kartoffeln, Zwiebeln, insbesondere Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
- · Blumeria graminis (echter Mehltau) an Getreide,
- 5 · Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
  - · Glomerella cingulata an Tee,
  - · Drechslera- und Bipolaris- Arten an Getreide und Reis,
  - · Mycosphaerella-Arten an Bananen und Erdnüssen,
  - · Plasmopara viticola an Reben,
- 10 · Personospora-Arten an Zwiebeln, Spinat und Chrysantemen,
  - · Phaeoisariopsis vitis und Sphaceloma ampelina an Grapefruits,
  - · Pseudocercosporella herpotrichoides an Weizen und Gerste,
  - · Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
  - · Puccinia-Arten und Typhula-Arten an Getreide und Rasen,
- 15 · Pyricularia oryzae an Reis,
  - · Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
  - · Stagonospora nodorum und Septoria tritici an Weizen,
  - · Uncinula necator an Reben,
  - · Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- 20 · Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie Paecilomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im 25 Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der

30 Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 35 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2 kg Wirkstoff pro ha.

40

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

45 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Mate-

rialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen über5 führt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube,
Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich
nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine
feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

10

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungs-

- 15 mittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im
  wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B.
  Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B.
  Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B.
- 20 Cyclohexanon), Amine (z.B.Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fett-
- 25 alkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sor-

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, 45 Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, ali-

bitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

phatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclo-

- 5 hexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.
- Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge-10 meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe

- 15 hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammo-
- 20 niumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 25 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

30

J. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

35

- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 1II. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6

  Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen

des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol

PCT/EP02/07893

Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in IV. einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 5 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%). 10

30

**WO** 03/009687

- 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit V. 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalinalpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-15 Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbin-VI. dung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-a-pyrrolidon und erhält 20 eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden im-VII. einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 25 30Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser 30 erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-a-35 sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, 40 die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von di-45 rekt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen rich-

PCT/EP02/07893

ten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

31

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder

- 10 in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermitttel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergieroder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit 15 Wasser geeignet sind.
- Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen

20 0,01 und 1%.

**WO** 03/009687

5

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew. -% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff 25 ohne Zusätze auszubringen.

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zuge-30 setzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der 35 z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

40 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridime-45 · thyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-

5

10

Zink-ethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)disulfid;

- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthal-säure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolinacetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid,
  2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, 0,0-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4- triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol,
  2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N', N'-dimethyl-N-phenyl-schwefel-25 säure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Me-30 thyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethylfuran-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-meth-35 oxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin 40 bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylpheny1)-2-methylpropy1]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-45 ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphen-

oxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-

33

5

20

dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol,

(2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-yl-methyl]-1H-1,2,4-triazol, a-(2-Chlorphenyl)-a-(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol,

1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,

- - Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,
     N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin,
     N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
- 25 · Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyr-rol-3-carbonitril,
- Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphe-nyl)-acrylsäuremorpholid, 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
  - sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat,

    1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycy-
- clohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat,
  DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-amino-butyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-ala-
- ninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphe-nyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbon-
- säureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbo-nyl)-2-methoximino]acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pen-tyl]-1H-1,2,4-triazol,
  2,4-Difluor-a-(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalko-

hol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-tri-fluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphen-yl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol, 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methyl-benzamid.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vor
10 schriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so
erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit
physikalischen Angaben aufgeführt.

15 Beispiel 1 Herstellung von 5,7-Dihydroxy-6-isopropyl-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

20

5

Eine Mischung von 14 g (0,17 mol) 3-Amino-1,2,4-triazol, 34,3 g (0,17 mol) Diethyl-2-isopropylmalonat und 50 ml Tributylamin wur25 den 6 h bei 180 °C gerührt. Dann wurde die Reaktionsmischung auf 70 °C abgekühlt, eine wäßrige Lösung von Natriumhydroxid (21g/200ml Wasser) zugegeben und die Mischung 30 min gerührt. Die organische Phase wurde abgetrennt und die wäßrige Phase wurde mit Diethylether extrahiert. Anschließend wurde die wäßrige Phase mit 30 konz. Salzsäure angesäuert und der sich bildende Niederschlag durch Filtration gesammelt. Nach Trocknen erhielt man 27 g (0,14 mol) der Titelverbindung.

Beispiel 2 Herstellung von 5,7-Dichlor-6-isopropyl-[1,2,4]-35 triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

40

Eine Mischung von 25 g (0,13 mol) 5,7-Dichlor-6-isopropyl[1,2,4]-triazolo[1,5-α]-pyrimidin (vgl. Bsp. 1) und 50 ml

45 Phosphoroxychlorid wurden 8 h refluxiert. Dann wurde das
Phosphoroxychlorid teilweise abdestilliert und der Rückstand in
eine Mischung aus Methylenchlorid und Wasser gegossen. Die orga-

35

nische Phase wurde abgetrennt, getrocknet und filtriert. Das Filtrat wurde vom Lösungsmittel befreit. Man erhielt 16 g (0,07 mol) der Titelverbindung (Schmelzpunkt 119 °C).

5 Beispiel 3 Herstellungvon 5-Chlor-6-isopropyl-7-cyclopentyl-amino-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

25 Beispiel 4 Herstellung von 7-Hydroxy-6-propyl-5-trifluormethyl-[1,2,4]-triazolo $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

Eine Mischung von 14 g (0,17 mol) 3-Amino-1,2,4-triazol, 38,4 g (0,17 mol) 3-Oxo-2-propyl-4,4,4-trifluorobutanoat und 50 ml Tri35 butylamin wurden 6 h bei 180 °C gerührt. Die Aufarbeitung erfolgte analog zu Bsp. 1. Nach Trocknen erhielt man 33 g (0,13 mol) der Titelverbindung.

36

Beispiel 5 Herstellung von 7-Chlor-6-propyl-5-trifluormethyl-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

5

35

Eine Mischung von 25 g (0,10 mol) 5,7-Dichlor-6-isopro
10 pyl-[1,2,4]-triazolo[1,5-α]-pyrimidin (vgl. Bsp. 4) und 50 ml

Phosphoroxychlorid wurden 8 h refluxiert. Die Aufarbeitung er
folgte analog zu Bsp. 2. Man erhielt 23 g (0,086 mol) der Titel
verbindung (Schmelzpunkt 63 °C).

15 Beispiel 6 Herstellung von 7-Cyclopentylamino-6-propyl-5-tri-fluormethyl-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

Eine Mischung von 0,13 g (1,5 mmol) Cyclopentylamin, 0,15 g (1,5 mmol) Triethylamin in 10 ml Methylenchlorid wurde unter Rühren zu einer Mischung von 0,40 g (1,5 mmol) 7-Chlor-6-propyl-5-trifluormethyl-[1,2,4]-triazolo-[1,5-α]-pyrimidin (vgl. Bsp. 5) in 20 ml Methylenchlorid gegeben. Die Reaktionsmischung wurde bei Raumtemperatur 16 h gerührt, die Aufarbeitung erfolgt analog zu 30 Bsp. 3. Man erhielt 0,39 g (1,24 mmol) der Titelverbindung (Schmelzpunkt 179 °C).

Beispiel 7 Herstellung von 7-Hydroxy-6-octyl-5-phenyl- [1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

Eine Mischung von 14,0 g (0,17 mol) 3-Amino-1,2,4-triazol, 51,7 g (0,17 mol) 3-Oxo-2-octyl-4-phenylbutanoat und 3 g p-Toluolsulfonsäure wurden 6 h refluxiert. Die Aufarbeitung erfolgte analog zu Bsp. 1. Nach Trocknen erhielt man 37 g (0,11 mol) der Titelver-45 bindung.

**Beispiel 8** Herstellung von 7-Chlor-6-octyl-5-phenyl-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

37

10 Eine Mischung von 17 g (0,05 mol) 7-Hydroxy-6-octyl-5-phenyl- [1,2,4]-triazolo-[1,5-α]-pyrimidin (vgl. Bsp. 7) und 50 ml Phosphoroxychlorid wurden 8 h refluxiert. Die Aufarbeitung erfolgte analog zu Bsp. 2. Man erhielt 16 g (0,046 mol) der Titelverbindung.

Beispiel 9 Herstellung von 7-Cyclopentylamino-6-octyl-5-phenyl-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin

15

40

Eine Mischung von 0,13 g (1,5 mmol) Cyclopentylamin, 0,15 g (1,5 mmol) Triethylamin in 10 ml Methylenchlorid wurde unter Rühren zu einer Mischung von 0,52 g (1,5 mmol) 7-Chloro-6-octyl-5-phenyl-[1,2,4]-triazolo-[1,5-α]-pyrimidin (vgl. Bsp. 8) in 20 ml Methylenchlorid gegeben. Die Reaktionsmischung wurde bei Raumtemperatur 16 h gerührt, die Aufarbeitung erfolgt analog zu Bsp. 3. Man erhielt 0,52 g (1,3 mmol) der Titelverbindung (Schmelzpunkt 81 °C).

35 Beispiel 10 Herstellung von 5-Cyano-6-octyl-7-diethylamino-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin [I-167]

Eine Mischung von 0,1 mol der Verbindung I-48 und 0,25 mol Tetraethylammoniumcyanid in 750 ml Dimethylformamid wurde etwa 16 Std. bei 20 bis 25 °C gerührt. Nach Zusatz von Wasser und Methyl-tert.Butylether wurden die Phasen getrennt. Die organische Phase wurde nach Waschen mit Wasser und Trocknen vom Lösungsmit-

38

tel befreit. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel 8,33 g der Titelverbindung.

<sup>1</sup>H-NMR:  $\delta$  in ppm: 8,5 (s); 3,65 (q); 2,9 (m); 1,7 (m); 1,3 (m); 5 1,2 (t); 0,9 (t).

Beispiel 11 Herstellung von 5-Methoxy-6-octyl-7-diethyl-amino-[1,2,4]-triazolo- $[1,5-\alpha]$ -pyrimidin [I-168]

H<sub>3</sub>CNCH<sub>3</sub>CH

Eine Lösung von 65 mmol der Verbindung I-48 in 400 ml wasserfr.

15 Methanol wurde bei 20 bis 25°C mit 71,5 mmol einer 30 %igen Natriummethanolat-Lösung versetzt, dann etwa 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand in Dichlormethan aufgenommen. Diese Lösung wurde mit Wasser gewaschen, dann getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Nach 20 Chromatographie an Kieselgel wurden 7,5 g der Titelverbindung erhalten.

1H-NMR: δ in ppm: 8,18 (s); 4,09 (s); 3,41 (q); 2,65 (m); 1,55 (m); 1,3 (m); 1,1 (t); 0,9 (t).

30

25

35

40

Tabelle 1

<del>ŗ</del>	<del></del>	<del></del>	···-	<del>-</del>	<del></del>	<del></del>			39			·							
phys. Daten (m.p.[°C]; TR[cm-1]: 1H-NMR & [rrm])	169	125	172	96	209	133	55	152	1543, 1521, 1451	136	1596, 1511, 1464	1511,	1513,	145	140	140	119	102	102
×	CI	CJ	C1	CJ	Cl	CI	CI	CI	CI	CI	CI	CI	CI	CJ	CI	Cl	CI	. C1	CI
R <sup>3</sup>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	. CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	l CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH2-CH3	CH2-CH3	CH2-CH3	CH2-CH3	CH2-CH3	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH2-CH3	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH2-CH3	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>
R <sup>2</sup>	H	2)2-	H	CH2-CH3	H	H	CH2-CH3		2) 2-	H	CH2-CH3	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	H
R1	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	Cyclopenty1	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	CH2-CF3	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	Cyclopentyl	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH- (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CH_2$ – $CH_3$	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
Nr.	T-1	I-2	I-3	T-4	I-5	9-I	L-I	T-8	6-I	I-10	I-11	I-12	I-13	I-14	I-15	I-16	I-17	I-18	I-19

Nr.		R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	×	phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm <sup>-1</sup> ]; <sup>1</sup> H-NMR ð [ppm])
20	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ –C $(CH_3)_3$	Ħ	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	C1	116
I-21	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	$CH_2-CH_3$	CI	1613, 1555, 1464
-22	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	CH2-CH3	CJ	1612, 1554, 1464
-23	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	Н	CH2-CH3	CJ	169
I-24	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	Н	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CJ	140
I-25	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	CH2-CH3	CJ	140
-26	H	н	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CJ	263
I-27	– (СН <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> СН (СН <sub>3</sub> ) (СН <sub>2</sub> )	2)2-	(CH2) 3-CH3	CJ	91
-28	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	H	(CH <sub>2</sub> ) 3-CH <sub>3</sub>	CI	125
I-29	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) 3-CH <sub>3</sub>	CJ	121
I-30	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	Н	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub>	CI	121
-31	$\mathrm{CH_2-CF_3}$	H	(СH <sub>2</sub> ) 3-СH <sub>3</sub>	CI	156
I-32	CH <sub>2</sub> -C (CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	СH <sub>2</sub> -СH (СH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CJ	180
I-33	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	$\mathrm{CH_2}^+\mathrm{CH}$ (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CJ	127
I-34	cyclopenty1	H	сн <sub>2</sub> - сн (сн <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	56
-35	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	$ m CH_2CH_3$	$_{\mathrm{CH}_{2}\overset{!}{-}\mathrm{CH}}\mathrm{CH}_{3}\mathrm{)}_{2}$	CJ	163
-36	СН (СН <sub>3</sub> ) -СН <sub>2</sub> -СН <sub>3</sub>	H	$_{\mathrm{CH_2-CH}}$ (CH <sub>3</sub> ) $_{\mathrm{2}}$	CJ	159
I-37	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	$^{\circ}$ CH (CH $^{3}$ ) $^{-}$ CH $^{2}$ – CH $^{2}$ – CH $^{3}$	CI	180
-38	cyclopentyl	Н	СН (СН <sub>3</sub> ) -СН <sub>2</sub> -СН <sub>2</sub> -СН <sub>3</sub>	CJ	127
-39	$CH_2CH_3$	CH2CH3	СН (СН <sub>3</sub> ) -СН <sub>2</sub> -СН <sub>2</sub> -СН <sub>3</sub>	CJ	56
I-40	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	H	СН (СН <sub>3</sub> ) -СН <sub>2</sub> -СН <sub>2</sub> -СН <sub>3</sub>	CI	163

Nr.	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R <sup>3</sup>	×	phys. Daten (m.p.[ $^{\circ}$ C]; IR[cm $^{-1}$ ]; <sup>1</sup> H-NMR $\delta$ [ppm])
I-41	$\mathrm{CH}_2\mathrm{-CF}_3$	H	СН (СН3) -СН2-СН2-СН3	CI	159
I-42	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CI	136
I-43	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	2)2-	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CI	140
I-44	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH2-CH3	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2927, 1597, 1508, 1462
I-45	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2926, 1613, 1553, 1464
I-46	– (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	2)2-	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2925, 1594, 1520, 1192
I-47	Cyclopenty1	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2927, 1612, 1554, 1059
I-48	$ m CH_2-CH_3$	CH2-CH3	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2927, 1598, 1511, 1466
I-49	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2927, 1597, 1561, 1457
I-50	$CH-(CH_3)_2$	CH3	$(CH_2)_7$ - $CH_3$	CI	2926, 1595, 1514, 1467
I-51	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – CH $(CH_3)_2$	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH <sub>3</sub>	CJ	2926, 1613, 1553, 1464
I-52	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	C1	2926, 1612, 1553, 1464
I-53	(S) $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$	H	(CḤ2) 7-CH3	CI	2926, 1612, 1552, 1463
I-54	$(R/S)$ CH $(CH_3) - C(CH_3)_3$	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2926, 1613, 1555, 1464
I-55	(R) $CH(CH_3) - C(CH_3)_3$	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2926, 1613, 1556, 1467
I-56	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	2925, 1612, 1556, 1466
I-57	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	Н	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI .	1619, 1533, 1146
I-58	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	Н	$(CH_2)_{7}$ - $CH_3$	CI	1620, 1542, 1146
I-59	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	CI	1619, 1541, 1146
09-I	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	СН (СН3) 2	C1	71
I-61	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	180

Nr.	$\mathbb{R}^1$	R2	R <sup>3</sup>	×	phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm-1]; <sup>1</sup> H-NMR 0 [ppm])
T-62	$\mathrm{CH_2-CH_3}$	$\mathrm{CH_2-CH_3}$	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	
I-63	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	G1	1592, 1506, 1454
I-64	CH- (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	85
I-65	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CH_2$ – $CH_3$	耳	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	1616, 1544, 1463
99-I	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	П	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	160
L9-I	(S) CH (CH $_3$ ) -CH $_2$ -CH $_3$	H	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C1	160
89-I	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Ħ	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	134
69-I	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) –CH (CH <sub>3</sub> ) $_2$	Ħ	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	120
1-70	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	120
L-71	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	2964, 1611, 1551
I-72	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	СḤ (СН3) 2	C1	64
I-73	(S) $CH(CH_3)-C(CH_3)_3$	H	СН (СН3) <sub>2</sub>	C1	64
I-74	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	H	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CI	1616, 1527, 1147
T-75	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	CḤ (CH <sub>3</sub> ) 2	C.1	70
9L-I	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub>	H	СH (CH <sub>3</sub> ) 2	C1	70
I-77	I	H	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	ĊĪ	271
I-78	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH2-CH3	Cyclopenty1	CJ	99
I-79	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	Cyclopenty1	CI	136
I-80	$CH_2-CH_3$	CH2-CH3	Cyclopentyl	CI	78
I-81	$(CH_2)_{2}-CH_3$	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	Cyclopenty1	CI	87
I-82	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH2-CH3	Cyclohexyl	CI	136

R1	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	×	phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm <sup>-1</sup> ]; <sup>1</sup> H-NMR δ [ppm])
CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Н	Cyclohexyl	CI	156
- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (СН	2)2_	Cyclohexyl	CI	151
Cyclopentyl	H	Cyclohexyl	CI	158
CH2-CH3	CH2-CH3	Cyclohexyl	C1	103
(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	Cyclohexy1	CI	139
СН- (СН3) 2	CH <sub>3</sub>	Cyclohexy1	CI	134
$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CH_2$ – $CH_3$	H	Cyclohexy1	C1	155
СН (СН <sub>3</sub> ) –СН <sub>2</sub> –СН <sub>3</sub>	H	Cyclohexyl	CI	155
(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	Н	Cyclohexyl	C]	155
$(R/S)$ CH $(CH_3)$ –CH $(CH_3)_2$	H	Cyclohexy1	GI	114
СН (СН3) -СН (СН3) 2	H	Cyclohexy1	G1	110
СН (СН3) -СН (СН3) 2	H	Cyclohexyl	CI	110
$(R/S)$ CH $(CH_3) - C(CH_3)_3$	Н	Cyclohexy1	CI	134
СН (СН3) -С (СН3) 3	H	Cyclohexy1	CI	116
CH (CH <sub>3</sub> ) –C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	Cyclohexy1	CI	116
$(R/S)$ CH $(CH_3)$ –CF <sub>3</sub>	Н	Cyclohexyl	CI	160
(R) $CH(CH_3)-CF_3$	Н	Cyclohexy1	CI	130
(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	Cyclohexyl	CI	130
$\mathrm{CH_2}\mathrm{-CF_3}$	H	Cyclohexyl	G]	167
- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (СН	2)2-	CH2-C <sub>6</sub> H5	CJ	144
$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH2-CH3	$CH_2 - (2-C1-C_6H_4)$	CJ	114
	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> - (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> )  CYCLOPENTYL  CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> )  CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> )  CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> )  CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> )  3) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> Cyclopentyl  CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	R1       R2         CH (CH3) 2       H         - (CH2) 2CH (CH3) 2       H         - (CH2) 2CH (CH3) (CH2) 2-CH3       CH2-CH3         CYClopentyl       H         CH2-CH3       CH2-CH3         CH-(CH3) 2       CH3         CH-(CH3) -CH2-CH3       H         CH (CH3) -CH2-CH3       H         CH (CH3) -CH2-CH3       H         CH (CH3) -CH (CH3) 2       H         CH (CH3) -CH (CH3) 2       H         CH (CH3) -CH (CH3) 3       H         CH (CH3) -C (CH3) 3       H         CH (CH3) -C (CH3) 3       H         CH (CH3) -C (CH3) 3       H         S) CH (CH3) -CF3       H         S) CH (CH3) -CF3       H         CH2-CF3       H         CH2-CF3       H	R <sup>1</sup> R <sup>2</sup> R <sup>3</sup> CH (CH <sub>3</sub> ) 2         H         Cyclohexyl           - (CH <sub>2</sub> ) 2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) 2-         Cyclohexyl           - (CH <sub>2</sub> ) 2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) 2-         Cyclohexyl           Cyclopentyl         H         Cyclohexyl           CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> Cyclohexyl           CH-(CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2         H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2         H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2         H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3         H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3         H         Cyclohexyl           CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3         H         Cyclohexyl           S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3         H         Cyclohexyl           S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3         H         Cyclohexyl           S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>3</sub> H         Cyclohexyl           S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>3</sub> H         Cyclohexyl           CH <sub>2</sub> - C

CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) = CH <sub>2</sub> - CH <sub>2</sub> - (2-C1-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )         CI         IR [cm-1]; 1H-N           2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) = CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> - CH <sub>2</sub> - CH-CH <sub>4</sub> C1         IR [cm-1]; 1H-N           3D = CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - CH <sub>2</sub> - CH-CH <sub>2</sub> C1         37           nntyl         H         CH <sub>2</sub> - CH-CH <sub>2</sub> C1         43           TH <sub>3</sub> ) - CF <sub>3</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         43           TH <sub>3</sub> ) - CF <sub>3</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         144           TH <sub>3</sub> ) - CF <sub>3</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         144           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         144           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         144           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         144            TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> C1         163           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> H         Cyclopropyl-methyl         C1         103           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> C1         114           TH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> C1         114	Nr.	R1	R2	, R3	Þ	phys. Daten (m.p.[°C];
- (CH <sub>2</sub> ) 2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>3</sub> ) 2- CH <sub>2</sub> -(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ) CI  - (CH <sub>2</sub> ) 2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) 2- CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> - (CH <sub>2</sub> ) 2CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) 2- CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CYClOpenty1	- 1	ľ			4	-1]; <sup>1</sup> H-NMR δ
CH2−C (CH3) = CH2         CH2−CH3         CH2−CH2         CI           − (CH2) 2CH (CH3) (CH2) 2−         CH2−CH3         CI           − (CH2) 2CH (CH3) (CH3) (CH2) 2−         H         CH2−CH2         CI           − (CH2) 2CH (CH3) −CF3         H         CYClOpropy1−methy1         CI           − (CH2−CF3) −CF3         H         CYClOpropy1−methy1         CI           − (CH2−CF3) − CH3         H         CYClOpropy1−methy1         CI           − (CH2−CF3) − CH3−CH3         CH2−CF3         CI           − (CH3−CF3) − CH2−CH3         CH2−CF3         CI           − (CH3−CH3) − CH3−CH3         H         CH2−CF3         CI           − (CH3) − CH2−CH3         H         CH2−CF3         CI           − (CH3) − CH3−CH3         H         CH2−CF3         CI           − (CH3) − CH2−CH3         H         CH2−CF3         CI           − (CH3) − CH(CH3) − CH2−CF3         CI           − (CH3) − CH (CH3) − CH(CH3) − CH3−CF3         CI	1	CE CE		$CH_2 - (2-C1-C_6H_4)$	IJ.	164
- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> ) - (CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub> Cyclopenty1	I-105	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$		CH2-CH=CH2	C1	55
Cyclopenty1         H         CH2_CH=CH3         C1           (R/S) CH(CH3) - CF3         H         Cyclopropy1_methy1         C1           CH2_CF3         H         Cyclopropy1_methy1         C1           CH2_CF3 - CF3         H         Cyclopropy1_methy1         C1           CH2_C CH3) 2         H         CH2_CH2_CM3         C1           CH2_C CH3) 3         H         CH2_CF3         C1           CYclopenty1         H         CH2_CF3         C1           CYclopenty1         H         CH2_CF3         C1           CA2_CH3_CH3         CH3_CH3         CH2_CF3         C1           CA2_CH3_CH3         CH3_CH3         CH2_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH2_CH3         H         CH2_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) - CH(CH3) 2         H         CH2_CF3_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) 2         H         CH2_CF3_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) 2         H         CH2_CF3_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) 3         H         CH2_CF3_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) 3         H         CH2_CF3_CF3         C1           (R/S) CH(CH3) - CH(CH3) 3         H         <	I-106		3) 2-	CH2-CH=CH2	CJ	37
(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-CF <sub>3</sub> H         Cyclopropy1-methy1         C1           CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> H         Cyclopropy1-methy1         C1           CH(CH <sub>3</sub> ) = CF <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN         C1           CH <sub>2</sub> -C (CH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           CH <sub>2</sub> -C (CH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> = CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         C1           CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> = CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         C1           CH-(CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         C1           (R) CH(CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) - CH	<u> </u>	Cyclopenty1	H	CH2-CH=CH2	C1	43
CH2-CF3 H CYClopropy1-methy1 C1 CH(CH3)2 H CH2-CH3-CM C1 CH(CH3)2 H CH2-CH3-CM C1 CH(CH3)2 H CH2-CF3 C1 CYClopenty1 H CH2-CF3 C1 CY2-CH3 CH3 CH2-CH3 CH2-CF3 C1 CY2-CH3 CH2-CH3 CH2-CF3 C1 CY2-CH3 CH2-CH3 CH2-CF3 C1 (CH2)2-CH3 CH2-CH3 CH2-CF3 C1 (CH2)2-CH3 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH2-CH3 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH2-CH3 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH(CH3)2 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH(CH3)3 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH(CH3)3 H CH2-CF3 C1 (R) CH(CH3)-CH(CH3)3 H CH2-CF3 C1	I-108	CH(CH <sub>3</sub> )	H	Cyclopropy1-methy1	C1	150
CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H CH <sub>2</sub> -CR <sub>2</sub> CN CI CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -C (CH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) = CH <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> CH <sub>3</sub> CH CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH CH <sub>3</sub> CH C	] [	CH2-CF3	H	Cyclopropyl-methyl	C1	144
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$			Ħ	CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CN	CI	211
CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> -CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH CH <sub>3</sub> -CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH CH <sub>3</sub> -CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH CH <sub>3</sub> -CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )-CH (CH <sub>3</sub> ) CH (CH <sub>3</sub> )	I-111	$CH_2-C(CH_3)=CH_2$	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	C1	84
Cyclopenty1         H         CH2-CF3         CI           CH2-CH3         CH2-CF3         CI           (CH2) 2-CH3         CH2-CF3         CI           (CH2) 2-CH3         CH2-CF3         CI           (CH-(CH3) 2.         CH3         CH2-CF3         CI           (R/S) CH(CH3) -CH2-CH3         H         CH2-CF3         CI           (R) CH(CH3) -CH2-CH3         H         CH2-CF3         CI           (R) CH(CH3) -CH2-CH3         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH(CH3) -CH(CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R) CH(CH3) -CH(CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH(CH3) -CH(CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH(CH3) -CH(CH3) 3         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH(CH3) -C(CH3) 3         H         CH2-CF3         CI	1 1		H	CH2-CF3	C1	151
CH2-CH3         CH2-CF3         CH2-CF3         CI           (CH2) 2-CH3         (CH2) 2-CH3         (CH2-CF3         CI           CH-(CH3) 2         CH3         CH2-CF3         CI           (R/S) CH-(CH3) - CH2-CH3         H         CH2-CF3         CI           (R) CH (CH3) - CH2-CH3         H         CH2-CF3         CI           (R) CH (CH3) - CH (CH3) - CH (CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R) CH (CH3) - CH (CH3) - CH (CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R) CH (CH3) - CH (CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH (CH3) - CH (CH3) 2         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH (CH3) - CH (CH3) 3         H         CH2-CF3         CI           (R/S) CH (CH3) - CH (CH3) 3         H         CH2-CF3         CI	I-113	Cyclopenty1	H	CH2-CF3	CI	163
(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH(CH <sub>3</sub> ) -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1	-	CH2-CH3	CH2-CH3	CH2-CF3	CJ	103
CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         CH <sub>2</sub> -CF <sub></sub>	I-115	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	CI	107
(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> C1	I-116	CH-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH2-CF3	CI	88
(R) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub> C1           (S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> - CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub> C1           (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub> C1         CH           (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>3</sub> H         CH <sub>2</sub> - CF <sub>3</sub> C1         CH	I-117		Н	CH2-CF3	C.I	131
(S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI	I-118	СН (СН3)	Ħ	CH2-CF3	C1	126
(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (S) CH (CH <sub>3</sub> ) - CH (CH <sub>3</sub> ) 2       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI	I-119		Ħ	CH2-CF3	CI	126
(R) $CH(CH_3)$ - $CH(CH_3$		CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> )	H	CH2-CF3	CI	114
(S) $CH(CH_3)$ - $CH(CH_3$	I-121	CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> )	Ħ	CH2-CF3	CI	112
(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI         (R) CH (CH <sub>3</sub> ) - C (CH <sub>3</sub> ) 3       H       CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> CI	I-122	СН (СН3) -СН (СН3)	H	CH2-CF3	CI	112
(R) $CH(CH_3) - C(CH_3)_3$ H $CH_2 - CF_3$ C1	1 1	S) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> )	Ħ	CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	CJ	110
	I-124	СН (СН3) -С (СН3)	Н	4	CI	105

Nr.	$\mathbb{R}^1$	R.2	R <sup>3</sup>	×	phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm <sup>-1</sup> ]; <sup>1</sup> H-NMR & [ppm])
I-125	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	CH2-CF3	CI	105
I-126	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CF_3$	H	$ m CH_2-CF_3$	CI	179
I-127	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	$ m CH_2-CF_3$	CI	125
I-128	(S) $CH(CH_3)-CF_3$	н	CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>	CI	125
I-129	H	H	CH2-CF3	C1	243
I-130	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	$CF_3$	. 91
I-131	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	, 3-	$(CH_2)_{7}$ - $CH_3$	$CF_3$	64
I-132	Cyclopenty1	ш	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	$CF_3$	84
I-133	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH <sub>3</sub>	CF3	177
I-134	CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CF3	162
I-135	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	2)2-	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	$CF_3$	108
I-136	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	$CF_3$	101
I-137	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Н	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	$CF_3$	101
I-138	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	$CF_3$	241
I-139	СН (СН3) 2	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH <sub>3</sub>	$C_6H_5$	83
I-140	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH (CH <sub>3</sub> ) (СH <sub>2</sub> )	2) 2-	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	$C_6H_5$	63
I-141	H	H	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	$C_6H_5$	163
I-142	- (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> СH (CH <sub>3</sub> ) (CH <sub>2</sub> )	2) 2-	Cyclopenty1	CI	2960, 1610, 1550, 1241
I-143	Cyclopentyl	Н	Cyclopenty1	CI	154
I-144	$CH-(CH_3)_2$	$CH_3$	Cyclopentyl	CI	2958, 1610, 1548, 1239
I-145	$(R/S)$ CH $(CH_3)$ – $CH_2$ – $CH_3$	Н	Cyclopentyl	CI	143

1	1	<del></del>	·	<del>-}</del>		7		<del></del>	Ţ.	<del></del>	± 0			<del></del>	<u> </u>			T	<del>-  </del>	· • · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm <sup>-1</sup> ]; <sup>1</sup> H-NMR & [ppm])	137	137	124	110	110	113	2962, 1610, 1550, 1241	2960, 1610, 1549, 1241	129	135	135	129	213	180	208	162	164	148	277	8,4(s); 8,2(m); 3,45(m); 1,95(m); 1,8(m); 1,6(m)
×	C.I	CI	CJ	CI	CI	CT	CI	CJ	CI	CI	CI	CF3	CF3	$CF_3$	$\mathbb{CF}_3$	$\mathbb{CF}_3$	$\mathbb{CF}_3$	$CF_3$	CI	CJ
. R <sup>3</sup>	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopenty1	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopentyl	Cyclopenty1	CH (CH <sub>3</sub> ) – (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> –CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> .	(CH <sub>2</sub> ) <sub>6</sub> -CH <sub>3</sub>	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -CH <sub>3</sub>	CH (CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) - (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -CH <sub>3</sub>	CH (CH2CH2CH3) 2	$CH(CH_3) - (CH_2)_3 - CH_3$	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	Cyclopentyl
$\mathbb{R}^2$	Ħ	H	H	H	二	I	H	II	耳	H	H	H	H	H	H	н	Ħ	H	Н	II
R1	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CH (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	(R/S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	(S) CH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -C (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	(R/S) CH (CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>	(S) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	(R) CH (CH <sub>3</sub> ) -CF <sub>3</sub>	H	Н	Н	H	H	H	H	П	Ħ
N.	I-146	I-147	I-148	I-149	I-150	I-151	I-152	I-153	I-154	I-155	I-156	I-157	I-158	I-159	I-160	I-161	I-162	I-163	I-164	I-165

Nr.	$\mathbb{R}^1$	$\mathbb{R}^2$	R3	×	phys. Daten (m.p.[°C]; IR[cm <sup>-1</sup> ]; <sup>1</sup> H-NMR & [ppm])
I-166	H	H	Cydlohexyl	CI	8,45(s); 8,2(m); 3,1(m); 2,1(m); 1,8(m); 1,55(m); 1,4(m)
I-167	$\mathrm{CH_2-CH_3}$	CH2-CH3	(CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> -CH <sub>3</sub>	CN	s. Beispiel 10
I-168	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	CH2-CH3	(CH <sub>2</sub> ) 7-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	s. Beispiel 11

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I 5 ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% NekanilR LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% WettolR EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

15 Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen Botrytis cinerea an Paprikablättern

Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 4 - 5 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wäßrigen 20 Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von Botrytis cinerea, die 1,7 x 10<sup>6</sup> Sporen/ml in einer 2 %igen wäßrigen Biomalzlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in

- eine Klimakammer mit 22 bis 24 °C und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefall auf den Blättern visuell in % ermittelt werden.
- 30 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-10, I-61, I-65, I-66, I-68, I-69, I-76, I-78, I-84, I-100, I-101, I-146 und I-153 bis I-155 keinen oder bis zu 15 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.
- 35 Anwendungsbeispiel 2 Wirksamkeit gegen den falschen Mehltau an Reben (*Plasmopara viticola*)

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 %

- 40 Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24 °C und an-
- 45 schließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30 °C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16

Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

5 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe I-8 bis I-10, I-19, I-25, I-27, I-49, I-60 bis I-62, I-69, I-84, I-101, I-113, I-133, I-146, und I-153 bis I-155 keinen oder bis zu 15 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 85 % befallen waren.

#### Patentansprüche

1. 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I,

5

10

20

25

in der die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:

15  $R^1$ ,  $R^2$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl; oder

5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom; oder

5- oder 6-gliedriges Heteroaryl enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom,

wobei  $\mathbb{R}^1$  und  $\mathbb{R}^2$ , wenn ungleich Wasserstoff, unabhängig voneinander teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe  $\mathbb{R}^a$ 

35

30

Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl-oxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy- $C_1$ - $C_4$ -alkylenoxy,

tragen können; oder

40

45

R¹ und R² können zusammen mit dem Stickstoffatom, das sie verbindet, einen 5- oder 6-gliedrigen Ring bilden, der ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom enthält, und der durch ein bis drei Reste aus der Gruppe R² substituiert sein kann;

WO 03/009687

51

 $C_1-C_{10}-Alkyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkenyl$ ,  $C_2-C_{10}-Alkinyl-$ ,  $C_3-C_8-Cycloalkyl$ , Phenyl- $C_1-C_{10}-Alkyl$ ,

wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R<sup>a</sup> tragen kann, oder

 $C_1-C_{10}$ -Haloalkyl, das ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^a$  tragen kann;

PCT/EP02/07893

10

Halogen, Cyano,  $C_1-C_4-Alkoxy$ ,  $C_1-C_4-Haloalkyl$ , Phenyl oder durch  $R^a$  substituiertes Phenyl;

sowie deren Salze.

15

- 2. 7-Aminotriazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X für Halogen steht.
- 3. Verfahren zur Herstellung von 7-Aminotriazolopyrimidinen der 20 Formel I nach Anspruch 1, in der X Halogen, Cyano oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man Dicarbonyl-verbindungen der Formel II.1,

wobei  $A^1$  und  $A^2$  für  $C_1-C_{10}-Alkoxy$  stehen, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III

$$N \longrightarrow NH_2 \qquad III$$

zu Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV.1

40

cyclisiert, die Hydroxytriazolopyrimidine der Formel IV.1 mit einem Halogenierungsmittel zu Halogentriazolopyrimidinen der Formel V.1

5

10

halogeniert, wobei Hal für Halogen steht, und anschließend mit einem Amin der Formel VI

15

20

zu 7-Aminotriazolopyrimidinen der Formel I , in denen X Halogen bedeutet, umsetzt, und zur Herstellung von 7-Aminotriazolopyrimidinen der Formel I, in denen X Cyano oder  $C_1-C_4$ -Alkoxy bedeutet, mit einer Verbindung der Formel VII ...

25

in der M ein Ammonium-, Tetraalkylammonium-, Alkalimetalloder Erdalkalimetallkation und X' Cyano oder Alkoxy bedeutet,
umsetzt.

4. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I nach Anspruch 1, in der X  $C_1$ - $C_4$ -Haloalkyl oder gegebenenfalls durch  $R^a$  substituiertes Phenyl bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man Dicarbonylverbindungen der Formel II.2

40

35

$$O$$
 $R^3$ 
 $X$ 
 $R^3$ 
 $X$ 

wobei  $A^1$  für  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxy und X für  $C_1$ - $C_4$ -Haloalkyl oder gegebenenfalls durch  $R^a$  substituiertes Phenyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III nach Anspruch 3 zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV.2

5

**WO** 03/009687

10

15

cyclisiert, die 7-Hydroxytriazolopyrimidine der Formel IV.2 mit einem Halogenierungsmittel zu 7-Halogentriazolopyrimidinen der Formel V.2

20

halogeniert, wobei Hal für Halogen steht, und anschließend mit einem Amin der Formel VI gemäß Anspruch 3 zu 7-Aminotriazolo-pyrimidinen der Formel I umsetzt.

5.

7-Hydroxy- und 7-Halogentriazolopyrimidine der Formeln IV und V,

30

35

wobei Y für eine Hydroxygruppe oder einen Rest aus der Gruppe X steht, Hal Halogen bedeutet und R<sup>3</sup> sowie X die folgenden Bedeutungen haben:

40

 $\rm R^3$   $\rm C_1-C_{10}-Alkyl,$   $\rm C_2-C_{10}-Alkenyl,$   $\rm C_2-C_{10}-Alkinyl-,$   $\rm C_3-C_8-Cyclo-alkyl,$  Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl,

45

wobei R<sup>3</sup> unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Reste aus der Gruppe R<sup>a</sup> tragen kann; und ferner

54

 $C_1$ - $C_{10}$ -Haloalkyl, das ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^a$  tragen kann;

 $R^a$  Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyloxy und gegebenenfalls halogeniertes  $C_3$ - $C_4$ -alkylenoxy,

10

X Halogen, Cyano,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Haloalkyl, Phenyl oder durch  $R^a$  substituiertes Phenyl;

- 6. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und ein 7-Aminotriazolo-pyrimidin der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
- 7. Verwendung der 7-Aminotriazolopyrimidine der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.
- 8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
  schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter
  mit einer wirksamen Menge der 7-Aminotriazolopyrimidine der
  allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

30

5

35

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Internal plication No PCT/EP 02/07893

A. CLASSI IPC 7	FICATION OF SUBJECT MATTER A01N43/90 C07D487/04 //(C07D4	487/04,249:00,239:00)	
According to	o International Patent Classification (IPC) or to both national classific	ation and IPC	
	SEARCHED		**************************************
Minimum do IPC 7	ocumentation searched (classification system followed by classificati AO1N CO7D	ion symbols)	
Documentat	tion searched other than minimum documentation to the extent that s	such documents are included in the fields se	arched
	ata base consulted during the international search (name of data ba		
EPO-In	ternal, WPI Data, PAJ, CHEM ÀBS Data	A .	
C. DOCUMI	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the rel	levant passages	Relevant to claim No.
X	EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARG 7 September 1994 (1994-09-07) abstract; claim 1	CH)	1-9
X	US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANE AL) 18 March 1997 (1997-03-18) examples 32,33,51,52	FRED ET	5
, <b>X</b>	WO 94 20501 A (SHELL INT RESEARCH KLAUS JUERGEN (DE); BECHER HEINZ 15 September 1994 (1994-09-15) examples 32,33,51,52		5
			٠,
Furti	her documents are listed in the continuation of box C.	Σ Patent family members are listed in	n annex.
"A" docume considuate de considuation de cume considuation de cume conseduate de cume conseduate de cume conseduate de cume conseduate de cons	ent which may throw doubts on priority claim(s) or is cited to establish the publication date of another n or other special reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or means ent published prior to the international filing date but han the priority date claimed	<ul> <li>"T" later document published after the interpriority date and not in conflict with cited to understand the principle or the invention</li> <li>"X" document of particular relevance; the cited annot be considered novel or cannot involve an inventive step when the document of particular relevance; the cited cannot be considered to involve an inventive an involve an inventive step with one or moderated to involve an inventive and involve an inventive step with one or moderated to inventive step with one or moderated to inventive step with one or moderated</li></ul>	the application but cory underlying the aimed invention be considered to cument is taken alone aimed invention rentive step when the re other such docuties to a person skilled
	actual completion of the international search	Date of mailing of the international sea	rch report
ļ	October 2002	09/10/2002	
Name and r	mailing address of the ISA  European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  NL – 2280 HV Rijswijk  Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl,  Fax: (+31–70) 340–3016	Authorized officer Fritz, M	

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interr plication No PCT/EP 02/07893

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)	Publication date
EP 0613900	A	07-09-1994	EP	0613900 A1	07-09-1994
			ĀT	153025 T	15-05-1997
			AU	672267 B2	26-09-1996
			ΑU	5633294 A	08-09-1994
			BG	61647 B1	27-02-1998
			BG	98637 A	31-01-1995
			BR	9400808 A	01-11-1994
			CA	2116946 A1	05-09-1994
			CN	1094407 A	02-11-1994
			DE	69403119 D1	19-06-1997
			DE	69403119 T2	28-08-1997
			DK	613900 T3	23-06-1997
			ES	2101429 T3	01-07-1997
			GR	3023587 T3	29-08-1997
			HK	1001054 A1	22-05-1998
			HU	68050 A2	29-05-1995
			IL	108731 A	18-03-1997
			JP	7002861 A	06-01-1995
			NZ	250955 A	27-04-1995
			OA	9891 A	15-09-1994
			RO	112869 B1	30-01-1998
			RU	2126408 C1	20-02-1999
			SG	48897 A1	18-05-1998
			US	5756509 A	26-05-1998
			ZA	9401484 A	10-11-1994
US 5612345	Α	18-03-1997	NONE	ر کے سے بہور ہندہ جنبہ کے کہ کے کہ کے کا کہ جب انظام کیا۔	
WO 9420501	Α	15-09-1994	AT	159722 T	 15-11-1997
•			AU	690899 B2	07-05-1998
			AU	6258094 A	26-09-1994
			BR	9405988 A	26-12-1995
			CA	2157293 A1	15-09-1994
			CN	1119015 A ,B	20-03-1996
			CZ	9502233 A3 <sup>°</sup>	17-01-1996
			DE	69406538 D1	04-12-1997
			DK	699200 T3	20-07-1998
			WO	9420501 A1	15-09-1994
			EP	0699200 A1	06-03-1996
			HK	1004332 A1	20-11-1998
			HU	73163 A2	28-06-1996
			IL	108747 A	12-03-1999
			JP	8507505 T	13-08-1996
			NZ	262729 A	26-01-1996
			PL	310467 A1	11-12-1995
			RU	2130459 C1	20-05-1999
			SG	48860 A1	18-05-1998
			SK	106895 A3	05-06-1996
			US	5854252 A	29-12-1998
			ZA	9401485 A	10-11-1994

#### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Intern ktenzeichen PCT/EP 02/07893

A. KLASSI IPK 7	FIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES A01N43/90 C07D487/04 //(C07D4	187/04,249:00,239:00)	
	ternationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klas	ssifikation und der IPK	
	RCHIERTE GEBIETE ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo	nle 1	
IPK 7	AO1N CO7D		
Recherchie	te aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, so	owelt diese unter die recherchierten Gebiete	fallen
	pa.		
_	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (N		Suchbegriffe)
EPO-In	ternal, WPI Data PAJ, CHEM ABS Data		
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	e der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP 0 613 900 A (SHELL INT RESEARC 7. September 1994 (1994-09-07) - Zusammenfassung; Anspruch 1	H)	1-9
X	US 5 612 345 A (BECHER HEINZ-MANF AL) 18. März 1997 (1997-03-18) Beispiele 32,33,51,52	RED ET	5
X	WO 94 20501 A (SHELL INT RESEARCH KLAUS JUERGEN (DE); BECHER HEINZ 15. September 1994 (1994-09-15) Beispiele 32,33,51,52		5
	ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu ehmen	χ Siehe Anhang Patentfamilie	•
"A" Veröffer aber n "E" älteres Anmel "L" Veröffer	ntlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, icht als besonders bedeutsam anzusehen ist.  Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen dedatum veröffentlicht worden ist.  atlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er-	<ul> <li>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur Erfindung zugrundeliegenden Prinzips Theorie angegeben ist</li> <li>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeu kann allein aufgrund dieser Veröffentlich erfinderischer Tätigkeit beruhend betra</li> </ul>	worden ist und mit der zum Verständnis des der oder der ihr zugrundeliegenden tung; die beanspruchte Erfindung hung nicht als neu oder auf obtet worden
andere soll od ausge "O" Veröffe eine B "P" Veröffe	en im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden in er die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie führt) intlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht intlichung, die vor dem internationalen. Anmeldedatum, aber nach internationalen.	"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeu kann nicht als auf erfinderischer Tätigkt werden, wenn die Veröffentlichung mit Veröffentlichungen dieser Kategorie in diese Verbindung für einen Fachmann "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben	tung; die beanspruchte Erfindung eit beruhend betrachtet einer oder mehreren anderen Verbindung gebracht wird und naheliegend ist
Datum des	Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Red	cherchenberichts
1	. Oktober 2002	09/10/2002	
Name und F	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2	Bevollmächtigter Bediensteter	
	NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016	Fritz, M	

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Interna Aktenzeichen
PCT/EP 02/07893

	echerchenbericht rtes Patentdokumer	1E	Datum der Veröffentlichung	ا 	Nitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP	0613900	Α	07-09-1994	EP	0613900 A1	07-09-1994
				ΑT	153025 T	15-05-1997
				AU	672267 B2	26-09-1996
				AU	5633294 A	08-09-1994
				BG	61647 B1	27-02-1998
				BG	98637 A	31-01-1995
				BR	9400808 A	01-11-1994
				CA	2116946 A1	05-09-1994
				CN	1094407 A	02-11-1994
				DE	69403119 D1	19-06-1997
				DE	69403119 T2	28-08-1997
				DK	613900 T3	23-06-1997
					2101429 T3	01-07-1997
	•			ES		29-08-1997
				GR	3023587 T3	22-05-1998
				HK	1001054 A1	
				HU	68050 A2	29-05-1995
				IL	108731 A	18-03-1997
				JP	7002861 A	06-01-1995
				NZ	250955 A	27-04-1995
	*			OA	9891 A	15-09-1994
				RO	112869 B1	30-01-1998
				RU	2126408 C1	20-02-1999
				SG	48897 A1	18-05-1998
				US	5756509 A	26-05-1998
				ZA 	9401484 A	10-11-1994
US	5612345	Α	18-03-1997	KEINE		
MO.	9420501	A	15-09-1994	AT	159722 T	15-11-1997
,,,		•		AU	690899 B2	07-05-1998
				AU	6258094 A	26-09-1994
				BR	9405988 A	26-12-1995
				CA	2157293 A1	15-09-1994
				CN	1119015 A ,B	20-03-1996
				CZ	9502233 A3	17-01-1996
				DE	69406538 D1	04-12-1997
				DK	699200 T3	20-07-1998
				WO	9420501 A1	15-09-1994
				EP	0699200 A1	06-03-1996
				HK	1004332 A1	20-11-1998
				HU	73163 A2	28-06-1996
	,			IL	108747 A	12-03-1999
				JP	8507505 T	13-08-1996
				NZ	262729 A	26-01-1996
				PL	310467 A1	11-12-1995
						20-05-1999
				RU	2130459 C1	
				SG	48860 -A1	18-05-1998
				SK	106895 A3	05-06-1996
				US ZA	5854252 A 9401485 A	29-12-1998 10-11-1994